EEST AVAILABLE COPY

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number:

53-072825

(43) Date of publication of application: 28.06.1978

(51)Int.Cl.

A01N 9/22 A01N 9/12

C07D213/81

(21)Application number : **51-147156**

(71)Applicant: CHUGAI PHARMACEUT CO LTD

(22)Date of filing:

09.12.1976

(72)Inventor: HOSODA KEIZO

KOIZUMI MASUO

TOGASHI KUNIHIKO

MURAKAMI YASUSHI

(54) FUNGICIEDS FOR AGRICULTURE AND HORTICULTURE

(57) Abstract:

PURPOSE: To prepare fungicides excellently effective against blast, helminthosporium leaf spot and sheath blight on rice plants, gray mold on vegetables or fruits.

LEGAL STATUS

[Date of request for examination]

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or

application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's

decision of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's

decision of rejection]

Searching PAJ Page 2 of 2

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office



公開特許公報

印特許出願公開

昭53-72825

6Nnt. Cl.² A 01 N 9/22 A 01 N 9/12 C 07 D 213/81

識別記号

52日本分類 庁内整理番号 30 F 371.221 6516-49 30 F 91 6712-49 16 E 431 7138-44

砂公開 昭和53年(1978) 6 月28日

発明の数 1 審査請求 未請求

(全 8 頁)

砂農園芸用殺菌剤

20特

顛 昭51-147156

29出

願 昭51(1976)12月9日

存発 明 者

者 細田恵三

東京都豐島区高田3丁目41番8号 中外製薬株式会社綜合研究

所内

小泉益男

同

東京都豊島区高田3丁月41番8 号 中外製薬株式会社綜合研究

所内

砂発 明 者 富樫邦彦

東京都豊島区高田3丁目41番8号 中外製薬株式会社綜合研究

所内

同 村上泰

東京都豊島区高田3丁目41番8号 中外製薬株式会社綜合研究

所内

⑪出 願 人 中外製薬株式会社

東京都北区浮間5丁目5番1号

似代 理 人 安藤憲章

明 組 響

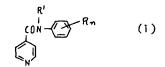
1. 発明の名称

2.特許謝水の範囲

一般式

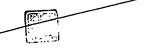
(式中以は鎖式または増式カルボン鍛炭店、ハログン原子、カルボ中シ店、低級アルキル店、ニトロ店、低級アルコキシ店、ジアルキルアミル店、アルコキシカルボニル店、アルコキシカルボニル店、アルキル店、水深原子を示し、 **は1~3の袋の下れる。他の袋を有効の分として含有することを特徴とする袋園芸用粉留剤。

3. 発明の詳細な説明 本発明は、一般式



(式中はは設式または堪式カルボン設践器、ハログン原子、カルボキン据、低級アルキル器、ニトロは、低級アルコキシ医、ベンジイル器、ジアルキルで、アルキルで、アルボールを、アルキンがの出ばれるでは、ない、のは1~3の監紋を示す。但し、のが2からし、のは1~3の監紋を示す。但し、のが2からし、のは1~3の監紋を示す。但し、ので表わるには、ので表わるには、ないのである。するわら、ヘルペテカときカアクのには、ないのである。である。

公知である。すなわち、ヘルペチカ ヒミカ アクタ(Helvetica Chimica Acta) <u>47</u>,1964,162~165 資およびジャーナル オブ ゼネラル ケミストリー オブ ザ ユーエスエスアール(Journal of General Chemistry of the USSR)<u>33</u>,1963,1232~1234



よびヘーミッシュ ベリヒテ(Chemische Beri) 91, 1958, 1388~1390頁に数値の化合物が 示されている。しかしながらこれらの値々の化 す物が幾幽芸用数値別として如何なる抗菌性を有 するかについては全く配載されていない。

本発明は、これらの公知化合物をよび新規化合物であつて、前記一般式(1)で提わされる特定の化合物を有効成分として含有してなる機協芸用殺菌別を提供するものである。特に稲の主要網接であり、近年各種果剤に対する耐性菌の出現により防験が出難視されているイモテ網をはじめとし、稲砂で変ないない。 数枯弱あるいは稲・蔵梁・果樹・花井などのうどんと網を通確に防除しうる新規楽剤を提供するものである。

近年機業技術の進歩に伴い省力化を目的として
数多くの機関要用殺菌剤が使用されている。しか
し、生産性を向上させるために同一作物における
各種の網客に対する同時防除性を巣偏した巣剤あるいは同一架剤で広範囲な作物網客を遅延に防除

本発明化台物の合成法を参考例として示す。 参考例.

イソニコチニール - 3,5 - ジクロロアニリド (化合物省号14)の製造

3.5 - ジクロロアニリン3.2 タを乾燥ビリジン20 Mに溶解し、常法により契したインニコテン銀クロリド塩酸塩3.6 タを氷冷境拌下1.5 分を要して加える。 ほられた反応退合物を超温にて1.2 時間投料後、ビリジンを放圧留去する。

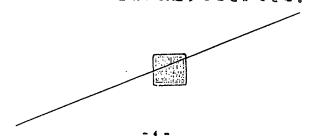
特別昭53-72825(2)

しりる延剤は少ないために有用な楽剤の出現が強 く選まれている。

本発明者られ、これらの点に鑑み新規で有用な 成凶芸用改歯剤を開発するべく種々の化合物を合 以し、その生物活性について検討した。その結果、 一般式(I)で表わされる化合物が最凶芸用殺歯剤と して個めて優れた防除活性を有することを見出し た。

本発明のこのような事実は公知文献の配収内容からは推考し避いものであり、全く新しい銀点から別収された認めて有用性の高い疑問受用股内別である。また、ヒトの水虫に対する采埋作用を調べたところ右干估性が見られた。

本発明の有効成分化合物は、次の反応式で示される方法によつて容易に製造することができる。

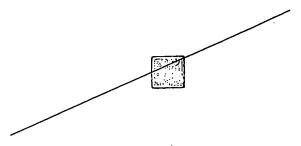


次いで残留物に5% 重炭酸ソーダ水溶液50 mを加え析出する結晶を炉取し、水洗後乾燥すると租イソニコチニール-3,5-ジクロロアニリド6.1 を得る。これをエタノールより再結晶すると得られた化台物は融点189~190 Cを示す。

元潔分析値: C12H8N2OCA2 として

C H N 計算値均 53.96 3.02 10.49 実関値均 53.79 2.94 10.38

次にこのような製造法によつて待られる一数式(1) 心化合物心代表例を第1 提に示すが、本発明は これら心例示化合物心外に限定されるものではない。なお、化台物普号は以下の実配例かよび実験 例にかいても診照される。



			勇	1 ₽			
ภ์			(Ra		
号		· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	H ₂	换 基 K ₃	H4	H ₅	(2)
1	н	н	Н	Н	Н	-cu√>	98~99
2	Н	Н	Н	-CB	н	-ω√∑	137~138
3	Н	Н	н	-Br	Н	-∞√	154~155
4	Н	Н	н	-CH ₃	Н	-∞-Ѿ	157~158
5	н	н	н	-CH ₃	H	-∞-()	110~111
6	н	Н	н	-COCH ₃	Н	Н	191~192
7	Н	н	-C.£	-C#	н	н	196~197
8	Н	-соон	н	н	н	н	285~286
9	Н	-соон	н	Н	Н	-CH ₃	182~183
10	Н	-соон	,-ce	н	Н	-C.£	183~184
11	Н	-C#	н	н	Н	-C.£	175~176
12	Н	Н	н	-CH ₃	н	Н	182~183
13	Н	-C#	Н	Н	-Cl	Н	147~148
14	Н	н	-CL	H	-ce	Н	189~190
				- 7 -			

15	н	-C ₂ H ₅	н	Н	н	-C ₂ H ₅	145~146
16	н	н	н	н	-NO ₂	н	243
17	н	н	-0CH3	н	Н	н	130~131
18	н	-NO ₂	н	н	н	н	121
19	н	н	н	-F	н	н	119~120
20	н	н	н	-OCH3	н	н	168~169
21	н	н	н	-ce	н	н	129~130
22	н	Н	н	-Br	н	н	167~168
23	н	н	Н	-NO ₂	н	н	221~222
24	н	н	*	н	н	н	136~137
25	н	-OCH3	н	н	-NO ₂	Н	171~172
26	н	-CH ₃	н	-NO ₂	н	н	169~170
27	н	-NU ₂	н	-OCH3	н	н	116~117
28	н	-NO ₂	н	-C.€	Н	н	209~210
29	н	Н	-CH ₃	-CH ₃	Н	н	101~102
30	н	Н	-CH3	H	-CH ₃	н	210~211
31	Н	-NO ₂	Н	-NO ₂	н	Н	193~194
32	Н	-ce	-c#	Н	н	Н	187~188
33	Н	-C.£	н	-C.£	Н	Н	119~120
34	Н	-CH ₃	н	-CH ₃	Н	-сн,	180~181

35	н	-ce	Н	-NO ₂	н	-c <i>e</i>	160~161
36	н	-CH ₃	н	н	н	-CH₃	144~145
37	н	Н	-CL	-СН₃	н	н	144~145
38	н	-CH ₃	-C&	н	н	н	182~183
39	н	-OCH ₃	-CA	Н	н	н	145~146
40	н	н	н	-w- <u>(</u>)	н	н	96~97
41	н	н	Н	-N CH3	н	н	226~227
42	Н	н	Н	()	Н	н	211~212
43	Н	-CN	н	-NO ₂	н	н	234~235
44	н	Н	-NO2	-CH ₃	н	н	139~140
45	Н	Н	н	-cooch (ch)	н	Н	143~144
46	-C₂H₅	Н	н	н	н	н	125~126
47	н	-OC2H5	н	-OC ₂ H ₆	Н	н	101~102
48	Н	-Br	Н	-Br	Н	-Br	119~120
49	Н	Н	н	-OH	Н	н	247~248
50	Н	-C£	н	-C£	Н	-C.L	138~139
51	н	-CH ₃	н	н	-CH ₃	Н	127~128

本発明の有効似分である化合物は農園芸用殺 題別として、突厥に使用する場合はそれ自体をそのま」使用することができるが、使用場面に応じて各個の基別と低合し、粉別、粒別、水和剤、緩剤、油剤、乳剤、エアソール、塩煙剤等の剤型としても使用することができる。

特別的53-72825(4)

テル塩類、石油スルホネート類、ジオクチ
ホサクシネート塩類、アルキルアリルスル
皮塩類等)、カテオン系(脂肪族アミン塩類、
数アンモニウム塩類、アルキルピリジニウム
道等)をよび両性系(アルキルアミノエチルグ
シン、アルキルジメチルベタイン、ポリグリコ
ール鑑慮エステル、アルキルアミンスルホン毀等)
の外面活性剤などがあげられる。

但し、本発明の実施超級は必らずしも上述の別型に限定されるものでないことはいうまでもない。また、本発明においては各位殺虫剤、殺菌剤、 酸草剤、植物成長調整剤、殺ダニ剤、殺礙虫剤、 酵引剤、忌避剤、植物栄養剤、肥料等と促用する ととにより、より広範囲の効果を期待することも

本発明の段階芸用投資剤は、約原欲生物の種類にもよるが、一般に100~500戸の機能に調整され使用することが望ましい。これを有容徴生物の発生部所に直接適用して効果をあげることは
勿論、発生の予想される部所に適用して効果をあ

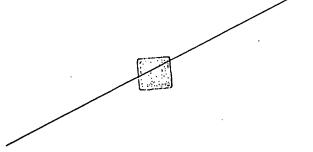
できる。

-11-

その後7日間ガラス張りの恒温室(23℃)に保り、発病した状態より楽剤の治病効果を比較した。

剛定は豊富に分生胞子を形成して明らかに無効である網路紋を紋えて一葉あたりの平均病斑紋を 求め、防除価の異定法式(次式)により治病効果 を求めた。

各処理区 4 枚のシャーレを供献し、1シャーレオオムギ生業 5 枚を供献したので1処理区の調査総数は20種である。その結果を第2段に示す。



げることもできる。

类成例 1.

本発明の設固芸用校園剤の実験例を以下に示す。なか、以下の実験例における化合物番号は、先に示した本発明化合物の具体例として示した第 1 投の化合物番号を示すものである。

オオムギのうどんと痢に対する防除効果

				
化合物奋号	调查能乘数	一葉当りの 平均病斑政	防途価 (%)	※ 害
7	20	0	100	なし
11	20	2.9	93.5	なし
13	20	o	100	なし
14	20	0.	100	なし
16	20	0.8	98.2	なし
17	20	· 0	100	なし
18	20	. 3.5	922	なし
19	20	0	100	なし
20	20	0.3	9 9.3	なし
21	20	0	100	なし
22	20	o	100	なし
23	20	3.5	922	なし
24	20	0	100	なし
25	20	0	100	なし
26	20	0	100	なし
27	20	2.9	9 3.5	なし
28	20	2.9	9 3.5	なし

29	20	0	100	なし
30	20	0	100	なし
33	20	0	100	なし
35	20	2.9	9 3.5	なし
37	20	0.8	9 8.2	なし
38	20	1 1.8	7 3.8	なし
39	20	1 0.0	7 7.8	なし
40	20	0	100	なし
41	20	0	100	なし
45	20	o	100	なし
47	20	1 1.8	7 3.8	なし
50	20	0	100	なし
₩ TPN	20	3.5	9 2.2	なし
Drc Drc	20	0.3	9 9.3	なし
	 	L	·	L

对照化合物

* TPN:テトラクロルイソフタニトリル(有効成分健康

750mm)水和剂

※※DPC:ジニトロメチルへブチルフエニールクロネート

(有劝成分健度 195pm)水和剂

-1,5 -

第 3 表

	i i				·
化合物	有劝政分	調査	一葉当りの	防除価	※ 書
沓 号	改度(四)	結業数	平均頻遊数	(%)	~ •
無処理区	÷	5 0	50	Ō	_
	150	4 8	0	100	なし
13	7 5	5 0	0	100	なし
14	150	5 0	0	100	なし
14	75	47	6	88	なし
1.7	150	5 0	0	100	なし
17	75	5 5	o	100	なし
19	150	5 0	0	100	なし
	75	4 7	5	90	なし
21	150	4 6	0	100	なし
	7 5	50	6	8 8	なし
22	150	5 0	0	100	なし
	7 5	5 0	0	100	なし
24	150	5 0	6	8 8	なし
2.3	75	4 8	1 2	7 6	なし
25	150	4 8	0	100	なし
	7 5	50	8	8 4	なし

尖段例 2.

オオムギのうどん こ树に 対する防 餘効果

その結果を明る段に示す。

-16-

26	150	5 0	0	100	なし
	7 5	5 0	10	80	なし
	150	5 3	0	100	なし
29	7 5	5 0	0	100	なし
30	150	5 0	0	100	なし
30	75	5 0	6	88	なし
0.0	150	5 0	0	100	なし
33	75	4 6	. 0	100	a L
4.0	150	4 6	0	100	なし
40	75	5 0	0	100	なし
	150	5 0	0	100	なし
41	75	5 0	8	84.	なし
45	150	5 0	0	100	なし
40	7 5	5 0	0	100	なし
50	150	5 0	0	100	なし
- 50	75	5 0	1 2	76	なし
*TPN	750	5 0	2	96	なし.
TPN	375	5 0	6	8 8	なし
DPC	195	5 0	0	100	なし
	9 7.5	5 0	4	9 2	なし

对照化合物:

※ TPN:テトラクロルイソフタロニトリル

※※DPC:ジニトロメチルへプチルフエニールクロネート

夹破钢 5.

中ユウリ灰色カビ病防鉄効果試験

温室内で最焼鉢に資収したキュウリ(ときわ) が本葉5~6枚に生育した時の幼苗を供収した。 关幅例2に単じて調整した水和剤を用いて所定認 近となるように水で布釈し遊集全面に政布した。 数布液址は9四の系統鉢当りキュクリ菌5個体化 対し30単の副台とした。梁成が乾いてから24 時间温室内に放置し、七の後パレイショ母地で培 ※した灰色カビ羽因(ポトリチス・サイオリア) を往5mのコルクポーラーで打扱き、 七のデイス 夕を乗回中央部に坂世した。坂祖校220周保証 世95%以上の展価室で24時间保り、七の设温 近(18~28℃)の多温ビニールペットで発轫 させた。没碰後6日目に無処理区の病理が最面全 体に進涎したとき、一葉当りの平均発病損収より 防除価を次式のようにして算出し各模剤の効果を 比較した。

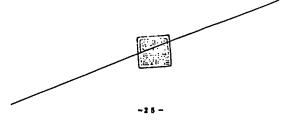
-23 -

夹跛例 6.

イネのイモテ朝間に対する抗国活性試験 直径 8 皿の炉紙円板を各估性化合物の100049 / 単態度のアセトン俗版に没渡成範疇、巡窩の寒 大平板培地を用いる拡散法によつて出止円形成の **朮滅により坑囪盾性を試験した。**

その結果を導り袋に示す。

化台物香号	兇止円の直径 (mm)
6	1 6.0
7	2 0.0
12	2 3. 0
14	1 2 0
15	1 3.0
無処埋区	0



七の結果を出る炎に示す。

化谷切 街	有勿必分 谜底(PP)	湖 蜇	一乗当りの 平均発病指数	防欲価 (名)	火 语
账价油 区	_	3 0	5. 0	0	1
	500	3 0	0	100	なし
33	250	30	· 0.2	96	なし
	125	3 0	1.2	76	なし
% TPN	750	30	0.5	9 0	なし
	375	30	1.3	7 4	なし

对照化合物:

*TPN: テトラクロルイソフタロニトリル 州6段の発明指政は火の超端による。

0:全球に発病が必められない

1:1/5 程度発病 2:2/5 程度発頻 3:1/2 程 成 発 病

4:1/2以上発病

5: 全葉に発病が認められる

-24-

次に本発明の災陥例を例示するが、これは必ら ずしも本発明の処方、化合物、使用基準などを限 足するものではない。

契雌例 1.

Ma 4 3 の化合物 5 郎(直旦郎を示す。以下の実 随例も何保)、ホワイトカーポン1部、クレー6 0部,タルク34部を混合、粉砕して粉剤として 用いる。

延馗例 2

ぬ 4 0 0 化 台 物 3 0 郎 , ホワイトカー ポン 1 0 邯・リグニンスルホン酸ナトリウム2郎。ポリオ キシエチレンノニールエーテル 2 前 , クレー 5 6 邸を促合、枌砕して水相削として用いる。

奥匹例 3.

Ma 4 8 の 化合物 2 0 邮 , ポリオキシアルキルア リルエーテルおよびアル中ルアリルスルホオート **延合物10部、キシロール20郎、シクロヘキサ** ノン50部を混合、裕解して乳剤として用いる。

代理人



手統補正督(自発)

昭和52年1月26日

特許庁長官 片山石 郎 跛

1. 事件の表示

将順昭51-147156号

2. 発明の名称

发幽芸用殺菌剂

3. 補正をする者

事件との関係 特許出頭人

住 所 果京都北区拌间 5 厂目 5 街 1 号

氏名(331)中外观察珠式会社

代段者 上 蚜 公 夫

4. 代 埋 人

住所 双京都登城区高田3丁目41番8号

带外裂 菜 株式 会 社 药

氏 名

安藤遊

5. 補正の対象

明細書の発明の詳細な説明の孏

6. 補正の内容 別紙の通り

-1-

3. 第23頁位下段の

「 無処理区の病斑数-処理区の病斑数 防餘価治= × 100 を 無処理区の網斑数

× 100 」 と訂正する

代理人 安藤 夏季

特明四53--72825(8) 補正の内容

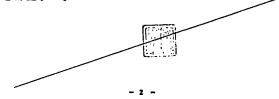
明淵母の配戦を次のとおり補正する。

1. 湖19頁下段より2行目の

×100 J と訂正する。

2 第22頁3行目の

と訂正する。



This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning Operations and is not part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

| BLACK BORDERS
| IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
| FADED TEXT OR DRAWING
| BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
| SKEWED/SLANTED IMAGES
| COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
| GRAY SCALE DOCUMENTS
| LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
| REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

OTHER: _

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.